

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開平10-306012

(43) 公開日 平成10年(1998)11月17日

(51) Int.Cl.⁶

識別記号

F I

A 6 1 K 7/00
7/025
7/42
7/48
47/38

A 6 1 K 7/00
7/025
7/42
7/48
47/38

F

N

審査請求 未請求 請求項の数36 O L (全 13 頁)

(21) 出願番号 特願平10-45876

(22) 出願日 平成10年(1998) 2月26日

(31) 優先権主張番号 8 0 7, 0 6 2

(32) 優先日 1997年 2月27日

(33) 優先権主張国 米国 (U S)

(71) 出願人 391023932

ロレアル

LOREAL

フランス国パリ, リュ ロワイヤル 14

(72) 発明者 パスカル・アルノー

フランス・94000・クルティユ・アヴェニ
ユ・ジェネラル・ペー・ピヨット・43

(72) 発明者 ボール・ソー

アメリカ合衆国・ニュージャージー・
07922・パークリー・ハイツ・ドッグウッ
ド・レーン・181

(74) 代理人 弁理士 志賀 正武 (外 9 名)

(54) 【発明の名称】 溶解エチルセルロースを含有する局所使用用の一価アルコールフリーの組成物

(57) 【要約】

【課題】 一価アルコールを含有せず、付着性、耐久性が改善され、化粧持ちがよく、移動の少ない化粧品用または製薬用組成物を提供する。

【解決手段】 ラノリン油、トリグリセリド、プロピレングリコールエステル、ネオペンチルグリコールエステル、脂肪アルコール、イソステアリルラクタート、およびそれらの混合物からなる群から選択される約10-98重量%の少なくとも1つの溶媒成分と約0.05-20重量%のエチルセルロースを混合する。

【特許請求の範囲】

【請求項1】 唇および皮膚からなる群から選択されるヒトの組織へ局所使用される一価アルコールフリーの組成物であって、該組成物が、商業的に許容可能なキャリアと、約0.05～20重量%のエチルセルロースを含有し、該エチルセルロースが、少なくとも1つの溶媒に実質的に溶解し、該少なくとも1つの溶媒が、組成物の重量の10重量%を越えて含有されていることを特徴とする組成物。

【請求項2】 少なくとも1つの溶媒が、約80℃～100℃の温度で、エチルセルロースを実質的に溶解させるのに十分な可溶化力を有していることを特徴とする請求項1記載の組成物。

【請求項3】 少なくとも1つの溶媒がラノリン油を含むことを特徴とする請求項2に記載の組成物。

【請求項4】 少なくとも1つの溶媒がヒマシ油を含むことを特徴とする請求項2に記載の組成物。

【請求項5】 少なくとも1つの溶媒が、 C_8-C_{10} のトリグリセリド、トリヘプタノイン、カプリル酸トリグリセリド、カプリン酸トリグリセリドおよびそれらの混合物からなる群から選択されるトリグリセリドを含むことを特徴とする請求項2に記載の組成物。

【請求項6】 少なくとも1つの溶媒が、プロピレングリコールジエチルヘキサノアート、プロピレングリコールジカプリラート、プロピレングリコールジカプラート、プロピレングリコールジペラルゴナートおよびそれらの混合物からなる群から選択されるプロピレングリコールエステルを含むことを特徴とする請求項2に記載の組成物。

【請求項7】 少なくとも1つの溶媒が、ネオペンチルグリコールジヘプタノアート、ネオペンチルグリコールジエチルヘキサノアートおよびそれらの混合物からなる群から選択されるネオペンチルグリコールエステルを含むことを特徴とする請求項2に記載の組成物。

【請求項8】 少なくとも1つの溶媒がオレイルアルコールであることを特徴とする請求項2に記載の組成物。

【請求項9】 少なくとも1つの溶媒がオクチルドデカノールであることを特徴とする請求項2に記載の組成物。

【請求項10】 少なくとも1つの溶媒がイソステアリルラクタートを含むことを特徴とする請求項2に記載の組成物。

【請求項11】 少なくとも1つの溶媒が、次の範囲内：

$$15.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2} \leq \delta d \leq 18.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2}$$

$$8.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2} \leq \delta a \leq 10.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2}$$

〔上式中、 $\delta a = (\delta p^2 + \delta n^2)^{1/2}$ 〕の溶解度パラメータ δa および δd を有する化合物を含むことを特徴

とする請求項2に記載の組成物。

【請求項12】 前記組成物が、一または複数の溶媒を含有し、該溶媒が、次の範囲内：

$$15.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2} \leq \delta d \leq 18.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2}$$

$$8.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2} \leq \delta a \leq 10.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2}$$

〔上式中、 $\delta a = (\delta p^2 + \delta n^2)^{1/2}$ 〕の範囲内の組合せ溶解度パラメータ δa および δd を有するものであることを特徴とする請求項2に記載の組成物。

【請求項13】 組成物が製薬用組成物であることを特徴とする請求項2に記載の組成物。

【請求項14】 製薬用組成物が、サンスクリーン用組成物、局所用組成物、皮膚病用ゲル状ビヒクル、疎水性の皮膚用保護剤、耐水性のゲル状ビヒクルまたは皮膚を保湿するトリートメント用組成物からなる群から選択されることを特徴とする請求項13に記載の組成物。

【請求項15】 組成物が化粧品用組成物であることを特徴とする請求項2に記載の組成物。

【請求項16】 化粧品用組成物が、棒状口紅、リップグロス、リップルージュ、疎水性で加圧されたパウダー状のバインダー、ヘアグロス、髪用コンディショナー剤、ほほ紅およびアイシャドウからなる群から選択されることを特徴とする請求項15に記載の組成物。

【請求項17】 皮膚または唇からなる群から選択されるヒトの皮膚へ局所使用される一価アルコールフリーの組成物の調製方法であって、該方法が、

(a) 1) ラノリン油；2) C_8-C_{10} のトリグリセリド、トリヘプタノイン、カプリル酸トリグリセリド、カプリン酸トリグリセリドおよびそれらの混合物からなる群から選択されるトリグリセリド；3) プロピレングリコールジエチルヘキサノアート、プロピレングリコールジカプリラート、プロピレングリコールジカプラート、プロピレングリコールジペラルゴナートおよびそれらの混合物からなる群から選択されるプロピレングリコールエステル；4) ネオペンチルグリコールジヘプタノアート、ネオペンチルグリコールジエチルヘキサノアートおよびそれらの混合物からなる群から選択されるネオペンチルグリコールエステル；5) オレイン酸アルコール、オレイルアルコールおよびそれらの混合物からなる群から選択される $C_{10}-C_{100}$ の脂肪アルコール；6) イソステアリルラクタート；および7) それらの混合物からなる群から選択される少なくとも1つの溶媒成分を約10-98重量%用意し、

(b) 約0.05-20重量%のエチルセルロースと溶媒を混合する、工程を含むことを特徴とする方法。

【請求項18】 前記方法が組成物の付着性を高めるために使用されることを特徴とする請求項17に記載の方法。

【請求項19】 前記方法が組成物の耐久性を高めるた

めに使用されることを特徴とする請求項17に記載の方法。

【請求項20】 エチルセルロースと混合する前に、溶媒の温度が、約80-100℃であることを特徴とする請求項17ないし19のいずれか1項に記載の方法。

【請求項21】 溶媒-エチルセルロースの混合物を加熱し、混合物の温度を約80-100℃に維持することを特徴とする請求項17ないし19のいずれか1項に記載の方法。

【請求項22】 溶媒とエチルセルロースの混合を、エチルセルロースの実質的に全量が溶解するまで続けることを特徴とする請求項17ないし19のいずれか1項に記載の方法。

【請求項23】 化粧品用組成物を調製するために使用される請求項17ないし19のいずれか1項に記載の方法。

【請求項24】 製薬用組成物を調製するために使用される請求項17ないし19のいずれか1項に記載の方法。

【請求項25】 少なくとも1つの溶媒が、次の範囲内：

$$15.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2} \leq \delta d \leq 18.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2}$$

$$8.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2} \leq \delta a \leq 10.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2}$$

[上式中、 $\delta a = (\delta p^2 + \delta n^2)^{1/2}$] の溶解度パラメータ δa および δd を有する化合物であることを特徴とする請求項17ないし19のいずれか1項に記載の方法。

【請求項26】 唇および皮膚からなる群から選択されるヒトの組織への、一価アルコールフリーの組成物の付着性を高めるための方法であって；該方法が、以下の成分：

(a) 1) ラノリン油；2) C_6-C_{30} のトリグリセリド、トリヘプタノイン、カプリル酸トリグリセリド、カプリン酸トリグリセリドおよびそれらの混合物からなる群から選択されるトリグリセリド；3) プロピレングリコールジエチルヘキサノアート、プロピレングリコールジカプリラート、プロピレングリコールジベラルゴナートおよびそれらの混合物からなる群から選択されるプロピレングリコールエステル；4) ネオペンチルグリコールジヘプタノアート、ネオペンチルグリコールジエチルヘキサノアートおよびそれらの混合物からなる群から選択されるネオペンチルグリコールエステル；5) オレイルアルコール；6) イソステアリルラクタート；および7) それらの混合物、からなる群から選択される少なくとも1つの溶媒に実質的に溶解された、約0.05-20重量%のエチルセルロースと；

(b) 組成物の全重量の10-98重量%で含有される

該溶媒；を含む組成物を該組織に適用することを含んでなる方法。

【請求項27】 前記方法が、ヒトの皮膚および唇からなる群から選択されるヒトの組織での一価アルコールフリーの組成物の耐久性を高めるために使用されるものであることを特徴とする請求項26に記載の方法。

【請求項28】 少なくとも1つの溶媒が、次の範囲内：

$$15.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2} \leq \delta d \leq 18.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2}$$

$$8.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2} \leq \delta a \leq 10.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2}$$

[上式中、 $\delta a = (\delta p^2 + \delta n^2)^{1/2}$] の溶解度パラメータ δa および δd を有する化合物であることを特徴とする請求項26または27に記載の方法。

【請求項29】 前記方法が、一または複数の溶媒を使用し、該溶媒が、次の範囲内：

$$15.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2} \leq \delta d \leq 18.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2}$$

$$8.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2} \leq \delta a \leq 10.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2}$$

[上式中、 $\delta a = (\delta p^2 + \delta n^2)^{1/2}$] の範囲内の組合せ溶解度パラメータ δa および δd を有するものであることを特徴とする請求項26または27に記載の方法。

【請求項30】 組成物が化粧品用組成物であることを特徴とする請求項26または27に記載の方法。

【請求項31】 組成物が製薬用組成物であることを特徴とする請求項26または27に記載の方法。

【請求項32】 製薬用組成物が、サンスクリーン用組成物、局所用組成物、皮膚病用ゲル状ビヒクル、疎水性の皮膚用保護剤、耐水性のゲル状ビヒクルまたは皮膚を保湿するトリートメント用組成物からなる群から選択されることを特徴とする請求項31に記載の方法。

【請求項33】 化粧品用組成物が、棒状口紅、リップグロス、リップルージュ、疎水性で加圧されたパウダー状のバインダー、ヘアグロス、髪用コンディショナー剤、ほほ紅およびアイシャドウからなる群から選択されることを特徴とする請求項30に記載の方法。

【請求項34】 少なくとも1つの溶媒が、ヒマシ油、プロピレングリコールモノイソステアレートおよびそれらの混合物からなる群から選択されることを特徴とする請求項26または27に記載の方法。

【請求項35】 少なくとも1つの溶媒がオクチルドデカノールであることを特徴とする請求項17、26または27に記載の方法。

【請求項36】 少なくとも1つの溶媒がヒマシ油であることを特徴とする請求項17、26、27のいずれか1項に記載の方法。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野と背景技術】本発明は、溶解(solubilized)エチルセルロースを含有する一価アルコールフリーの組成物に関する。特に、この発明は、商業的に許容可能なキャリアと溶解エチルセルロースを含有し、ヒトの唇および皮膚に局所使用される一価アルコールフリーの組成物に関する。エチルセルロースは、天然油、トリグリセリド、プロピレングリコールエステル、ネオペンチルグリコールエステル、脂肪アルコールもしくはそれらの混合物である、少なくとも1つの可溶化剤(溶媒)に、実質的に溶解している。溶解セルロースは、組成物が適用される皮膚または唇への、組成物の付着性および耐久性を高めるのに十分な量で存在する。

【0002】本発明の可溶化剤は、置換されていて、置換されていなくてもよく、また飽和または不飽和であってよい。加えて、可溶化剤は、次の範囲内：

$$15.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2} \leq \delta d \leq 18.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2}$$

$$8.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2} \leq \delta a \leq 10.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2}$$

[上式中、 $\delta a = (\delta p^2 + \delta n^2)^{1/2}$] の溶解度パラメータ δa および δd を有する化合物であってよい。

【0003】本発明の組成物は、溶媒混合物を形成するために、一以上の溶媒を含有し得る。前記溶媒混合物は、上述した範囲内の溶解度パラメータ δa および δd を有する。

【0004】本発明では、化粧品用または製薬用組成物において、エチルセルロースと組合せて上述した溶媒を使用することにより、一価アルコールを含有しない組成物に、有効量のエチルセルロースを、より容易に溶解させることができ、よって、ヒトの皮膚または唇においてより耐性のある、改善された組成物を製造することができるといった利点がある。

【0005】また本発明は、溶解エチルセルロースを含有する前記一価アルコールフリーの組成物を有する、化粧品用または製薬用組成物の調製方法にも関する。

【0006】エチルセルロースは、セルロースのエチルエーテルであり、アセタール結合により互いに結合したアンヒドログルコースユニットからなる長鎖のポリマーを含有する。溶解エチルセルロースは疎水性の皮膜形成剤および化粧品用または製薬用組成物の水不溶性ポリマー成分として機能することが知見されている。また、化粧品用または製薬用組成物へ溶解エチルセルロースを導入することにより、これらの組成物の付着性、耐久性、粘度、および疎水性度が高められることが知見されている。

【0007】例えば、皮膚および唇用の化粧品用または製薬用組成物へ溶解エチルセルロースを導入することにより、このような組成物の付着性が高められ、よって、これらの組成物が適用される領域を越える所望しない移

動(migration)が軽減または最小化されることが見出されている。化粧品用または製薬用組成物が、その意図された表面へ付着する度合いは、消費者にとっては、特に棒状口紅、リップグロスおよび他の唇および皮膚の手入れ用製品において、重要な特徴である。

【0008】さらに、溶解エチルセルロースは、唇または皮膚に適用される化粧品用または製薬用組成物の耐久性を高め、よって、それらの組成物の耐摩擦性(wearability)を改善し、これらの組成物が適用される唇または皮膚領域と接触する可能性のある物品への所望しない移り(transfer)が低減または最小化されることが見出されている。加えて、溶解エチルセルロースは、化粧品が適用される領域、例えば唇または皮膚の特定領域を越えた、化粧品の所望しない移動を最小化することが見出されている。多くの唇および皮膚用の組成物は、着色および他のしみの原因となる薬剤を含有しているため、これらの組成物の所望しない移りを除去または最小化することは、消費者にとって重要な特徴である。またさらに溶解エチルセルロースは、耐水性を高め、皮膚上における皮膜形成能を増加させ、サンスクリーンにおける皮膚の保護ファクター(SPF)を増加させることが見出されている。

【0009】しかしながら、エチルセルロースは、化粧品用または皮膚病用組成物において見出されているほとんどの溶媒に対し、非常に限られた溶解度しか有さない。典型的には、約2~8の炭素原子を有する一価アルコール、例えばエタノール、ブタノール、メタノールまたはイソプロパノールが、化粧品用または製薬用組成物において、有効量のエチルセルロースをより容易に可溶化させるために使用されている。しかしながら、一価アルコール溶媒を使用することの欠点は、それらが刺激性を有し揮発性であり、繰り返し使用することで、結果として皮膚に害をなすおそれがあることである。よって、一価アルコールフリーで、そこに含有される溶解エチルセルロースが有効量である組成物、特に化粧品用または製薬用組成物が必要とされている。

【0010】従って、本発明の目的の一つは、組成物中に実質的に全てのエチルセルロースを可溶化させるために使用される一価アルコールを含有しない、ヒトの組織に局所使用される組成物を提供することにある。これは、有利には、一または複数の次の溶媒：天然油、 C_6 - C_{30} のトリグリセリド、プロピレングリコールエステル、ネオペンチルグリコールエステル、 C_{10} - C_{100} の脂肪アルコール、および次の範囲内：

$$15.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2} \leq \delta d \leq 18.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2}$$

$$8.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2} \leq \delta a \leq 10.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2}$$

[上式中、 $\delta a = (\delta p^2 + \delta n^2)^{1/2}$] の溶解度パラメータ δa および δd を有する化合物、またはそれらの

混合物を使用して、エチルセルロースを溶解させることにより達成される。

【0011】このような組成物が化粧品への応用、例えばヒトの唇または皮膚に適切な組成物において有用であることはこの発明の特徴である。特に、本発明の唇用の化粧品用組成物は、長時間化粧持ちし、リップラインの上下への所望しない移動が最小である。

【0012】本発明の他の特徴は、本発明の組成物が、ヒトまたは動物への局所投与を介して、製薬的に有効な成分を付与するために使用される組成物、または皮膚病用途を含むがこれに限定されない、製薬用途において有用であることである。

【0013】この発明の他の目的は、このような一価アルコールフリーの組成物を調製するための方法を提供することにある。この方法は、有利にはこのような可溶化を達成するための一価アルコールの使用を避けながら、実質的に全てのエチルセルロースを溶解させるように、エチルセルロースと上述した溶媒とを混合することにより成し遂げられる。この発明の他の特徴は、前記方法が化粧品用組成物の調製に有用であることである。またこの発明の他の特徴は、前記方法が製薬用組成物の調製に有用であることである。

【0014】この発明の他の特徴は、改善された付着性および耐久性を有する組成物の調製に有用な方法を提供することである。さらにこの発明の他の目的は、唇または皮膚における組成物の付着性および耐久性を高める方法を提供することである。

【0015】

【発明の概要】本発明は、唇および皮膚からなるグループから選択される、ヒトの組織に局所使用される一価アルコールフリーの組成物に関する。組成物は、商業的に許容可能なキャリアと溶解エチルセルロースを含有する。エチルセルロースは、80℃～100℃の温度でエチルセルロースを溶解させるのに十分な可溶化力を有する少なくとも1つの溶媒に実質的に溶解させられる。エチルセルロースは、組成物が適用される唇または皮膚への組成物の付着性および耐久性に寄与するのに十分な量で存在する。

【0016】本発明の好ましい実施態様において、組成物は：

(a) 約0.05重量%～約20重量%の溶解エチルセルロース；および

(b) 約10重量%～約98重量%の、天然油、 C_6 ～ C_{30} のトリグリセリド、プロピレングリコールエステル、ネオペンチルグリコールエステル、 C_{10} ～ C_{100} の脂肪アルコール、次の範囲内：

$$15.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2} \leq \delta d \leq 18.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2}$$

$$8.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2} \leq \delta a \leq 10.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2}$$

[上式中、 $\delta a = (\delta p^2 + \delta n^2)^{1/2}$]の溶解度パラメータ δa および δd を有する化合物、またはそれらの混合物から選択される少なくとも1つの溶媒を含有する。

【0017】本発明の組成物は、前記溶媒の溶解度パラメータが共に、 δa および δd について上述の範囲内にある、一以上の溶媒をさらに含有してもよい。

【0018】組成物は、化粧品用または製薬用組成物、またはそれらの成分として、特に有用である。

【0019】また本発明は、工程：

(a) 天然油、 C_6 ～ C_{30} のトリグリセリド、プロピレングリコールエステル、ネオペンチルグリコールエステル、 C_8 ～ C_{100} の脂肪アルコール、上述した範囲内の溶解度パラメータを有する化合物、およびそれらの混合物から選択される少なくとも1つの溶媒を約10～98重量%用意し；

(b) 約0.05～20重量%のエチルセルロースと溶媒とを混合する；工程を含む、一価アルコールフリーの組成物の調製方法に関する。

【0020】該方法は、皮膚もしくはボディにおける疾病または他のダメージを防止または治療するのに有効な製薬用組成物を含むがこれに限定されない、化粧品用または製薬用組成物の調製に特に有用である。

【0021】本発明の組成物は、エチルセルロースを含有しない組成物と比べて、改善された付着性および耐久性を示す。これらの組成物から、溶解エチルセルロースが、唇または皮膚における化粧品用または製薬用組成物の付着性の改善、特に組成物が適用される領域を越える所望しない移動の減少に必須の成分であることが見出された。さらに、溶解エチルセルロースは、唇または皮膚における化粧品用または製薬用組成物の耐久性の改善に必須の成分であることも見出された。またさらに、溶解エチルセルロースは、組成物が適用される領域を越える所望しない該組成物の移動を最小化または低減させることも見出された。この特徴は、唇用の化粧品用組成物、および皮膚に局所的に適用される組成物において、特に有用である。加えて、本発明の組成物は、一価アルコールを含有せず、このような組成物を、繰り返し使用した後の唇または皮膚に対する耐摩擦性が低減され、耐性が増大したものとする。

【0022】従って、本発明は、

(a) 天然油、 C_6 ～ C_{30} のトリグリセリド、プロピレングリコールエステル、ネオペンチルグリコールエステル、 C_8 ～ C_{100} の脂肪アルコール、上述した範囲内の溶解度パラメータを有する化合物、およびそれらの混合物からなるグループから選択される少なくとも1つの溶媒を約10～98重量%用意し；

(b) 一価アルコールの不在下で、約0.05～20重量%のエチルセルロースと溶媒を混合する；工程を含む、組成物の付着性および耐久性を高める方法に関する

る。

【0023】

【発明の実施の形態】一価アルコール溶媒の不在下で、20%までの溶解エチルセルロースを含有し、高い効力を有する非刺激性の組成物が、天然油、トリグリセリド、プロピレングリコールエステル、ネオペンチルグリコールエステル、脂肪アルコールおよびそれらの混合物とエチルセルロースとを混合することにより調製されることが見出された。さらに、エチルセルロースは、次の範囲内：

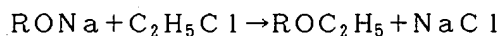
$$15.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2} \leq \delta d \leq 18.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2}$$

$$8.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2} \leq \delta a \leq 10.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2}$$

〔上式中、 $\delta a = (\delta p^2 + \delta n^2)^{1/2}$ 〕の溶解度パラメータ δa および δd を有する化合物に溶解せらる。

【0024】この発明の目的のために、この明細書および付随する特許請求の範囲において使用される「一価アルコール」という用語は、2～8の炭素原子と1つのヒドロキシル官能基を有するアルコール、例えばエタノール、ブタノール、メタノールまたはイソプロパノールであると定義される。従って、この明細書および付随する特許請求の範囲において使用される「一価アルコールフリー」という用語は、一価アルコールを含有せず、特に一価アルコールを排除した組成物を称するものである。

【0025】エチルセルロースは、アセタール結合により互いに結合したベター-アンヒドログルコースユニットの鎖を含有するセルロースエーテルである。各々のアンヒドログルコースユニットは、3つの置換可能なヒドロキシル基を有しており、その全てまたは一部は、次の反応：



で示されるように反応し得る。

【0026】3つのヒドロキシル基全てが完全に置換すると、各々のアンヒドログルコースユニットは、置換値が3になるか、またはエトキシル含有量が54.88%になる。本発明で使用可能なエチルセルロースのポリマーは、好ましくは、アンヒドログルコースユニット当りに2.5～2.60の置換値、または44～50%のエトキシル含有量を有するポリマーである。本発明では、一価アルコールの不在下にて、組成物の全重量に基づいて約0.05重量%～約20重量%のエチルセルロースを含有する。エチルセルロースの好ましい量は、全組成物の約0.05～約10重量%である。

【0027】本発明において適切に使用されるエチルセルロースポリマーの具体例には、ダウ・コーニング (Dow Corning) 社 (ミシガン州、ミッドランド) で製造され、「エトセル・スタンダード・7FP・プレミアム」および「エトセル・スタンダード・100FP・プレミアム」(以下、それぞれ「エトセル7FP」および「エトセル100FP」と称す) を含む商品名「エトセル (ETHOCEL)」として販売されているものが含まれるが、これに限定されない。これらのエチルセルロースポリマーの物理的性質を表Iに示す。この発明での使用に適した他の商業的に入手可能なエチルセルロース製品には、「Kタイプ」、「Nタイプ」および「Tタイプ」と称され、ヘルクレス (Hercules) 社 (デラウェア州、ウィルミントン) により製造販売されているものが含まれる。

【0028】

【表1】

表 1

記載	エトセル 7 F P	エトセル 1 0 0 F P
20%のエタノールと80%のトルエンの混合物における5%（重量）のポリマーの25℃での粘度測定はユビヘロディデ（ubhelodyde）粘度計を使用して行う	6.0-8.0cp	90.0-110.0cp
エトキシル含有量	48.0-49.5%	48.0-49.5%
粒子径・最大	140 μ m	150 μ m
粒子径・平均	5-15 μ m	30-60 μ m

【0029】また本発明は、エチルセルロースを有する均質系の形成を可能にする溶媒を含有する。「均質系」という用語は、ここでは、エチルセルロースと溶媒を含有する系（例えば、液体、固体、ゲルまたはガス）を意味するものと定義され、ここで、エチルセルロースは、実質的にまたは完全に溶媒に溶解している。本発明の溶媒は、好ましくは80℃～100℃の温度でエチルセルロースを溶解させるのに十分な可溶化力を有するものである。この発明の目的のために、この明細書および付随する特許請求の範囲において使用される「可溶化力」という用語は、溶媒が特定の温度で、実質的にエチルセルロースを溶解させるための該溶媒の能力として定義されるものである。

【0030】この発明で使用される適切な溶媒は、天然油、トリグリセリド、プロピレングリコールエステル、ネオペンチルグリコールエステル、脂肪アルコール、次の範囲内：

$$15.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2} \leq \delta d \leq 18.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2}$$

$$8.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2} \leq \delta a \leq 10.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2}$$

【上式中、 $\delta a = (\delta p^2 + \delta n^2)^{1/2}$ 】の溶解度パラメータ δa および δd を有する化合物、またはそれらの混合物である。

【0031】本発明では、このような溶媒を個々に、またはそれらを任意に組合せて、組成物の全重量に基づいて約10重量%～約98重量%含有し得る。溶媒の好ま

しい全量は、組成物の全重量に基づいて約60～95%である。

【0032】本発明の溶媒成分において適切に使用される天然油には、植物および動物から得られる油が含まれる。特に好ましいこのような油の具体例には、ヒマシ油、ラノリン油、ヒマシ油およびそれらの任意の誘導体が含まれる。

【0033】本発明の溶媒成分において適切に使用されるトリグリセリドは、約6～30の炭素原子を有する。特に好ましい適切なトリグリセリドの具体例には、 C_8 ～ C_{10} のトリグリセリド、トリヘプタノイン（triheptanoin）、カプリル酸およびカプリン酸のトリグリセリド、例えばカプリル酸トリグリセリドおよびカプリン酸トリグリセリドおよびそれらの混合物が含まれる。

【0034】本発明の溶媒として使用可能なプロピレングリコールエステルには、カプリル酸、カプリン酸またはベラルゴン酸のプロピレングリコールジエステルが含まれる。特に好ましいこのような化合物の具体例には、プロピレングリコールジカプリラート、プロピレングリコールジカプラート、プロピレングリコールジベラルゴナートおよびそれらの混合物が含まれる。本発明で 사용되는他の好ましいプロピレナルアルコールエステルには、プロピレングリコールジエチルヘキサノアートおよびプロピレングリコールモノイソステアラートが含まれる。本発明で好ましく使用される適切なネオペンチルグリコールエステルの具体例には、ネオペンチルグリコールジエチルヘキサノアートおよびネオペンチルグリコー

ルジヘパタノアートおよびそれらの混合物が含まれる。本発明で好ましく使用される他のエステル具体例には、イソステアリルラクタートが含まれる。

【0035】本発明の溶媒成分において使用可能な脂肪アルコールは、10～100の炭素原子を有し、分枝状または直線状の鎖の脂肪アルコールであってよい。脂肪アルコールが室温でロウ（すなわち固体）である場合には、このようなロウの融点で、エチルセルロースの可溶化がなされ得る。本発明で好ましく使用される適切な脂肪アルコール具体例には、オレイルアルコール、オクチルドデカノールおよびそれらの混合物が含まれる。

【0036】また、次の範囲内：

$$15.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2} \leq \delta d \leq 18.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2}$$

$$8.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2} \leq \delta a \leq 10.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2}$$

化合物

ヒマシ油

アロピレングリコールモノイソステアラート

イソステアリルラクタート

オレイルアルコール

$\delta a \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2}$ $\delta d \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2}$

16.79 9.09

16.36 8.74

16.36 8.74

16.28 8.17

【0039】本発明の実施態様の一つにおいて、組成物は化粧品用組成物である。他の実施態様において、この発明の組成物は製薬用組成物である。

【0040】ヒトの皮膚に有害な紫外線を、少なくとも部分的にブロックするために、この発明の組成物に、サンスクリーン剤を導入してもよい。この発明の化粧品用組成物に使用される有機サンスクリーン剤には、紫外線を吸収、ブロック、または低減させる任意の有機サンスクリーン剤が含まれる。何ら本発明を限定することなく、このような抗日光用組成物には、p-アミノ安息香酸、2-エトキシエチル-p-メトキシシナマート、ジエタノールアミン-p-メトキシシナマート、ジガロイルトリオレアート、2,2-ジヒドロキシ-4-メトキシベンゾフェノン、エチル-4-ビス(ヒドロキシプロピル)アミノベンゾアート、2-エチルヘキシル-2-シアノ-3,3-ジフェニルアクリラート、エチルヘキシル-p-メトキシシナマート、2-エチルヘキシルサリチラート、アミノ安息香酸グリセリル、3,3,5-トリメチルシクロヘキシルサリチラート、ジヒドロキシアセトンを含むローソン(lawson)、アントラニル酸メンチル、2-ヒドロキシ-4-メトキシベンゾフェノン、アミル-p-ジメチルアミノベンゾアート、2-エチルヘキシル-p-ジメチルアミンベンゾアート、2-フェニルベンゾイミダゾール-5-スルホン酸、赤ワセリン(red petrolatum)、2-ヒドロキシ-4-メトキシベンゾフェノン-5-スルホン酸、トリエタノールアミンサリチラート等が含まれるが、これらに限定されるものではない。加えて、抗日光用組成物に使用される適切なサンスクリーン剤は、「サンスクリーン

[上式中、 $\delta a = (\delta p^2 + \delta n^2)^{1/2}$]の溶解度パラメータ(δa および δd)を有する化合物を、本発明の溶媒として使用することもできる。

【0037】化粧品および製薬工業で使用される化合物の溶解度パラメータは、「コスメティック・ベンチ・リファレンス(Cosmetic Bench Reference)」[キャロル・ストリーム(Carol Stream)IL、アルラード(Allured)出版社(1992)]、および「溶解度パラメータおよび他の付着度パラメータのハンドブック(The Handbook of Solubility Parameters and Other Cohesion Parameters)」[第2版、ボカ・ラトン(Boca Raton)、CRCプレス(1992)]に記載されている。化合物の溶解度パラメータ δa および δd は、通常の当業者により決定されるであろう。

【0038】本発明の溶媒成分において使用可能な上述した範囲内の化合物は、次のようなものである：

剤のモノグラム(Sunscreens Monogram)」[連邦規則、第58巻、第90号、提案規則(Proposed Rule s)、頁28295(1993年5月12日)B部]に記載されている。本発明で使用される好ましいサンスクリーン剤は、商品名「パーソル(PARSOL)」として製造されているもの、例えば「パーソルMCX」、メトキシケイ皮酸オクチル(OMC)、および「パーソル1789」であり、両方とも、ギバウダン・ローレ(Givaudan Roure)社から入手することができる。

【0041】本発明は、これらのサンスクリーン剤またはその混合物を、約2重量%～約15重量%含有し得る。サンスクリーン剤の全量は、好ましくは、得ようとするSPF値に依存する。このような量は、当業者により確認されるであろう。

【0042】本発明は、シリコン成分、例えば揮発性で環状のシリコン、または揮発性で直鎖状短鎖のシリコン、非揮発性で直鎖状のシリコン、またはエチレンオキシド/プロピレンオキシドのシリコンコポリマー、および液状シリコン(silicone fluids)の混合物をさらに含有してよい。エチレンオキシド/プロピレンオキシドのシリコンコポリマー成分は、本発明に導入されて、組成物中に水分が存在する範囲において、水中油型または油中水型エマルジョンを形成する。エチレンオキシド/プロピレンオキシドのシリコンコポリマーは界面活性剤である。本発明で使用可能なシリコン成分具体例には、シクロメチコン、ジメチコン、ジメチコン-シリコンのコポリマー、例えばジメチコンコポリオールおよびステアロキシジメチコンが含まれるが、これらに限定されるものではない。

【0043】さらに、本発明は、これらのシリコン成分またはそれらの混合物を、約1重量%～約45重量%含有し得る。シリコン成分の全量は、好ましくは、得られる製品に依存し、通常の当業者により決定されるであろう。

【0044】またさらに本発明は、当業者に良く知られているような、化粧品用または製薬用組成物に典型的に使用される、一または複数の商業的に許容可能なキャリアを含有し得る。このようなキャリアには、エモリエント、界面活性剤、保湿剤、および水が含まれる。このようなキャリアの全量は、組成物の全重量の約0.1%～90%の範囲内にある。使用されるキャリアの種類は、得られる製品に依存し、通常の当業者により決定されるであろう。

【0045】本発明の化粧品用組成物は、当業者に良く知られているような、化粧品用または製薬用組成物に典型的に使用される、他の成分をさらに含有し得る。例えば、揮発性成分、例えばシクロメチコンまたはイソドデカンが、本発明の化粧品用組成物、例えばヘアグロス、リップグロス、棒状口紅、ほほ紅およびアイシャドウ用組成物に使用される。また、このような成分は、皮膚病用ゲルビヒクル中に、本発明の化粧品用または製薬用組成物にも使用される。このような成分により、典型的には、乾燥が促進され、表面の油分が減少し、改善された皮膜形成が得られる。本発明は、このような揮発性成分を、約2重量%～45重量%含有し得る。

【0046】本発明の組成物は、

(a) 天然油、 C_6-C_{30} のトリグリセリド、プロピレングリコールエステル、ネオペンチルグリコールエステル、 C_8-C_{100} の脂肪アルコール、次の範囲内：

$$15.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2} \leq \delta d \leq 18.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2}$$

$$8.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2} \leq \delta a \leq 10.00 \text{ (J/cm}^3\text{)}^{1/2}$$

[上式中、 $\delta a = (\delta p^2 + \delta n^2)^{1/2}$]の溶解度パラメータ δa および δd を有する化合物、およびそれらの混合物から選択される少なくとも1つの溶媒を約10～95重量%用意し；

(b) 約0.05～20重量%のエチルセルロースと溶媒を、約80℃～約100℃の温度で混合する；工程を使用することにより調製され得る。

【0047】また、この発明の方法では、一以上の溶媒で、該溶媒の溶解度パラメータ δa および δd が、共

に、上述した特定の範囲内にある溶媒を使用する。

【0048】この発明の方法の特に好ましい実施態様においては、エチルセルロースと混合する前の溶媒の温度は、約80～100℃である。他の好ましい実施態様では、溶媒-エチルセルロースの混合物を加熱し、混合温度を、約80～100℃に維持する。混合は、エチルセルロースの実質的に全部が溶解されるまで、機械的または他の手段を介して続けられる。また混合は、窒素加圧下で、またはそうではない状態で続けられ、さらに開放または閉塞容器中で続けられる。

【0049】上述した方法は、化粧品用または製薬用組成物を調製するために使用され得る。また上述した方法は、組成物、特にここで記載したような化粧品用または製薬用組成物の付着性、耐久性を高めるためにも使用され得る。

【0050】本発明の範囲内に入る化粧品用または製薬用組成物の種類には、棒状口紅、リップグロス、疎水性で加圧されたパウダー状のバインダー、ヘアグロス、髪用コンディショナー剤、疎水性の皮膚用保護剤、ほほ紅、アイシャドウ、サンスクリーン剤、並びに製薬的に局所適用されるもの、例えば皮膚病用ゲル状ビヒクル等が含まれるが、これらに限定されるものではない。

【0051】また、本発明は、ヒトの組織、特に唇または皮膚における、組成物の付着性および耐久性を高める方法を含む。前記組織に適用することを含む前記方法において、組成物は、成分として、その10～98重量%の、ここで記載された任意の溶媒またはそれらの混合物、および0.05～20重量%の、ここで記載されたエチルセルロースまたはそれらの混合物を含有する。このような方法において使用されるこのような組成物には、ここで記載された化粧品用または製薬用組成物が含まれるが、これらに限定されるものではない。

【0052】

【実施例】本発明をさらに例証するために次に組成物の実施例を記載する。しかし、ここで開示する実施態様に本発明が限定されるものではない。また、本発明は、その思想もしくは範囲から逸脱しない範囲で、特に例証され記載されたもの以外の方法で実施することもできる。

【0053】実施例1

(比較テスト) 本発明を例証する2つの一価アルコールフリーのリップルージュ組成物を、次のようにして調製した：

成分 (対照体)	組成物A (重量%)	組成物B (重量%)
エトセル100FP	1.00%	—
A相		
ヒマシ油	23.15	23.15
オクチルドデカノール	23.15	23.15
リンゴ酸ジイソステアリル	23.15	23.15

B相

ラノリン	10.88	11.85
ポリエチレンロウ	7.32	7.32
カルナウバロウ	2.44	2.44
顔料	8.44	8.44
防腐剤	適量	適量
香料	適量	適量

【0054】エトセル100FPをA相の成分と混合した。95℃でホモジナイズした後、ラノリン、ロウおよび顔料を添加した。顔料をひき、香料と防腐剤を添加した後、リップルージュを棒状口紅用の適切な形状の型に注いだ。

【0055】組成物Aと組成物Bを唇の半分に適用し、各々の組成物の付着性を比較した。特に、リップラインの上下における各々の組成物の移動を比較した。可溶化エトセル100FPを含有する組成物Aにおいては、可溶化エトセルを含有しない組成物Bよりも、所望しない移動がかなり少ないことが観察された。この比較テストにより、組成物にエチルセルロースを含有せしめることで、エチルセルロースを含有しないものよりも、このような組成物の化粧持ちを長くさせ、付着性が改善されることが証明された。

【0056】実施例2

エトセル100FPを、4時間、ゆっくりとしたスピードの均質混合により、85-90℃でヒマシ油と混合した。その結果得られた4%のエトセル100FPの溶液は、ヒマシ油中で非常に透明であり、室温でかなりの高粘度のゲルを形成した。

【0057】4%のエトセル100FP/ヒマシ油のゲルを唇に適用したところ、水分と接触した後、唇上に乾燥した疎水性の皮膜を形成して、改善された皮膜形成特性および付着性を示した。この実施例における好ましいエトセル100FPの濃度は、約0.50%~2.5%である。

【0058】実施例3

ヒマシ油ベース中に0.5~1.0%のエトセル7FPを含有する一価アルコールフリーの組成物を、エチルセ

ルロースを含有しない比較組成物と比較した。

【0059】ヒマシ油中に0.5%~1.0%のエトセル7FPを含有せしめた棒状口紅ベースは：(1)唇上に配された棒状口紅の緩衝性および粘度を高め；(2)唇への「乾燥度合い(dry down)」および付着性を改善し；(3)棒状口紅皮膜の疎水性度を増し；(4)耐久性を改善した。

【0060】実施例4

エトセル7FPプレミアムを、100℃で攪拌しつつ、次の一または複数の溶解成分中に分配することにより、5%の質量比率で溶解させた：

トリヘプタノイン
ネオペンチルグリコールジヘプタノアート
プロピレングリコールジベラルゴナート
プロピレングリコールジエチルヘキサノアート
ネオペンチルグリコールジエチルヘキサノアート
プロピレングリコールモノイソステアラート
オレイルアルコール
イソステアリルラクタート
オクチルドデカノール
ヒマシ油

C₈-C₁₀のプロピレングリコールジエステル
カプリン酸トリグリセリドおよびカプリル酸トリグリセリド

【0061】エトセル7FPを溶解させた後、混合物を室温まで冷却した。部分的に半透明または透明な混合物が得られ、室温で安定したままであった。

【0062】実施例5

本発明を例証する2つの一価アルコールフリーのリップケア用の化粧品用組成物を次のようにして調製した：

成分	重量%
エトセル7FP	7.00
トリヘプタノイン	30.00
ヒマシ油	26.00
カプリン酸トリグリセリドおよびカプリル酸トリグリセリド	37.00
	100.00
成分	重量%
エトセル100FP	4.00
オクチルドデカノール	75.60
オクチルドデシルステアロイルステアラート	20.00
防腐剤	適量
	100.00

【0063】上述した全ての成分を一緒に検量し、95

℃に加熱した。ホモジナイズした後、混合物を室温まで

冷却した。その結果、この組成物は、唇に直接、またはリップルージュの皮膜上に適用するのに適切な、油性混合物になった。唇に適用した場合、組成物は、組成物を適用した使用者の唇の外観を向上させた。

成分	重量%
エトセル7FP	5.00
A相	
ヒマシ油	28.00
オクチルドデカノール	28.00
フェニルトリメチコーン	28.00
B相	
ポリエチレンロウ	6.00
マイクロクリスタリンワックス	3.00
顔料、真珠母	2.00
	100.00

【0065】エチルセルロースをA相の成分と95℃で混合した。ホモジナイズした後、B相の成分、ついで顔料と真珠母を添加した。混合物を小さなポットに注ぎ、ゆっくりと室温まで冷却した。この組成物は、改善され

成分	重量%
エトセル100FP	4.00
A相	
リンゴ酸ジイソステアリル	39.00
アロピレングリコールジカプリラート/ジカプラート	39.00
B相	
シクロメチコーン	10.00
C相	
顔料	8.00
	100.00

【0067】エトセル100FPをA相の成分と95℃で混合した。ついで顔料を添加し、粉碎した。最後にB相を80℃で添加し、混合物を適切な密封容器に注いだ。

【0068】製品は、アプリケーションまたはブラシで唇に

成分	重量%
エトセル7FP	5.00
A相	
ヒマシ油	20.00
オクチルドデカノール	20.00
フェニルトリメチコーン	20.00
B相	
ラノリン	15.00
ポリエチレンロウ	5.00
カルナウバロウ	6.00
顔料	8.00
防腐剤	適量
香料	適量

【0070】エトセル7FPをA相の成分と混合した。95℃でホモジナイズした後、ラノリン、ロウおよび顔料を添加した。顔料をひき、香料と防腐剤を添加した

【0064】実施例6

本発明の一価アルコールフリーのリップグロス用組成物を、次のようにして調製した：

た付着性および耐久性を有するグロス用組成物になった。

【0066】

成分	重量%
エトセル100FP	4.00
A相	
リンゴ酸ジイソステアリル	39.00
アロピレングリコールジカプリラート/ジカプラート	39.00
B相	
シクロメチコーン	10.00
C相	
顔料	8.00
	100.00

適用することができた。

【0069】実施例7

本発明の一価アルコールフリーのリップルージュを、次のようにして調製した：

成分	重量%
エトセル7FP	5.00
A相	
ヒマシ油	20.00
オクチルドデカノール	20.00
フェニルトリメチコーン	20.00
B相	
ラノリン	15.00
ポリエチレンロウ	5.00
カルナウバロウ	6.00
顔料	8.00
防腐剤	適量
香料	適量

後、リップルージュを棒状口紅用の適切な形状の型に注いだ。

【0071】実施例8

本発明の一価アルコールフリーの色移りのないリップル

ージュを、次のようにして調製した：

成分	重量%
エトセル7FP	3.00
A相	
オクチルドデカノール	25.00
フェニルトリメチコーン	8.00
B相	
ポリエチレンロウ	15.00
顔料	9.0
シクロメチコーン	40.00
	100.00

【0072】エトセル7FPをA相の成分と混合した。95℃でホモジナイズした後、ロウおよび顔料を添加した。顔料を粉碎し、揮発性のシリコーンを添加した後、リップルージュを棒状口紅を製造するために適切な形状

の型に注いだ。

【0073】実施例9

本発明の一価アルコールフリーで耐水性のサンスクリーン用ゲルを、次のようにして調製した：

	重量%
エトセル100FP	4.00
プロピレングリコールジカプリラート／ジカプラート	33.00
リンゴ酸ジオクチル [バン・ディック (Van Dyk) 社のセラフィル (Ceraphyl) 45]	45.00
オクトクリレン (Octocrylene)	10.00
パーソル1789	3.00
メチルオキシシケイ皮酸オクチル (OMC)	5.00
	100.00

【0074】透明で、耐水性のあるゲル状ビヒクルが得られた。ゲルは、改善された付着性および耐久性を示した。

【0075】実施例10

本発明の、保護、保湿用のスキントリートメント用ゲルを、次のようにして調製した：

	重量%
エトセル100FP	5.00
プロピレングリコールジカプリラート／ジカプラート	30.00
リンゴ酸ジオクチル	30.00
シクロメチコーン	35.00
	100.00

【0076】シクロメチコーンが蒸発した後に、皮膚状に柔軟な皮膜を形成する、透明なゲル状組成物が得られた。このゲルは、皮膚病用のゲル状ビヒクルとして使用することができる。特に、このようなゲルは、皮膚または皮膚表面下に、製薬用活性剤を付与するのに使用する

ことができる。

【0077】実施例11

本発明の高粘度のゲル状組成物を、次のようにして調製した：

	重量%
エトセル100FP	18.50
プロピレングリコールジカプリラート／ジカプラート	40.75
リンゴ酸ジオクチル	40.75
	100.00

【0078】エトセルを溶媒に溶解し、室温まで冷却した後、リジッドで透明なゲルが形成された。

本発明の皮膚病用ビヒクル組成物を、次のようにして調製した：

【0079】実施例12

	重量%
エトセル100FP	4.50
プロピレングリコールジカプリラート／ジカプラート	30.50
リンゴ酸ジオクチル	15.00

イソプロピルヒドロキシステアレート	15.00
大豆ステロール [ヘンケル社のジェネロール (Generol) 122]	2.00
プロピレングリコール	2.00
シクロメチコーン	31.00
	100.00

【0080】製薬用活性剤を、この組成物と共に使用することもできる。

【0081】実施例13

疎水性の皮膜を形成する、皮膚の保護および皮膚に光沢を付与する（グロス）組成物を、次のようにして調製した：

	重量%
エトセル7FP	12.0
プロピレングリコールジカプリレート／ジカプラート	26.5
リンゴ酸ジオクチル	26.5
シクロメチコーン	35.0
	100.00